

# PATENT COOPERATION TREATY

**PCT**

## NOTIFICATION OF THE RECORDING OF A CHANGE

(PCT Rule 92bis.1 and  
Administrative Instructions, Section 422)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

ACKERMANN, Joachim  
Postfach 11 13 26  
60048 Frankfurt am Main  
ALLEMAGNE

TECH CENTER 1600/2900

NOV 08 2001

RECEIVED

<b>Date of mailing (day/month/year)</b> 12 June 2001 (12.06.01)	
<b>Applicant's or agent's file reference</b> 1998/F116 PCT	<b>IMPORTANT NOTIFICATION</b>
<b>International application No.</b> PCT/EP99/07084	<b>International filing date (day/month/year)</b> 23 September 1999 (23.09.99)

1. The following indications appeared on record concerning:

☐ the applicant
 ☐ the inventor
 ☐ the agent
 ☐ the common representative

<b>Name and Address</b>  	<b>State of Nationality</b>	<b>State of Residence</b>
	<b>Telephone No.</b>	
	<b>Facsimile No.</b>	
	<b>Teleprinter No.</b>	

2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:

☒ the person
 ☐ the name
 ☐ the address
 ☐ the nationality
 ☐ the residence

<b>Name and Address</b> ACKERMANN, Joachim Postfach 11 13 26 60048 Frankfurt am Main Germany	<b>State of Nationality</b>	<b>State of Residence</b>
	<b>Telephone No.</b> 49-69 92033-801	
	<b>Facsimile No.</b> 49-69 92033-7	
	<b>Teleprinter No.</b>	

3. Further observations, if necessary:

**The above-mentioned person should be entered into the record copy as the agent of record.**

4. A copy of this notification has been sent to:

<input checked="" type="checkbox"/> the receiving Office	<input type="checkbox"/> the designated Offices concerned
<input type="checkbox"/> the International Searching Authority	<input checked="" type="checkbox"/> the elected Offices concerned
<input type="checkbox"/> the International Preliminary Examining Authority	<input type="checkbox"/> other:

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland  Facsimile No.: (41-22) 740.14.35	<b>Authorized officer</b>  Ingrid Aulich  Telephone No.: (41-22) 338.83.38
---	--

From the INTERNATIONAL BUREAU

## PCT

### NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

To:

Assistant Commissioner for Patents  
United States Patent and Trademark  
Office  
Box PCT  
Washington, D.C. 20231  
ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

<b>Date of mailing (day/month/year)</b> 18 May 2000 (18.05.00)	
<b>International application No.</b> PCT/EP99/07084	<b>Applicant's or agent's file reference</b> 1998/F116 PCT
<b>International filing date (day/month/year)</b> 23 September 1999 (23.09.99)	<b>Priority date (day/month/year)</b> 09 October 1998 (09.10.98)
<b>Applicant</b> HAACK, Karl-Josef et al	

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

☒ in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:  
11 March 2000 (11.03.00)

☐ in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

2. The election ☒ was  
☐ was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland  Facsimile No.: (41-22) 740.14.35	<b>Authorized officer</b>  <p style="text-align: center;">Claudio Borton</p> Telephone No.: (41-22) 338.83.38
---	---

SCA

## PATENT COOPERATION TREATY

WO 00/21971  
PCT/EP99/07084

SCA

9500

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

AVENTIS RESEARCH & TECHNOLOGIES  
GMBH & CO KG  
Patent- und Lizenzabteilung  
Industriepark Höchst  
Gebäude K 801  
D-65926 Frankfurt am Main  
ALLEMAGNE

**NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE  
COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL  
APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES**

(PCT Rule 47.1(c), first sentence)

Date of mailing (day/month/year) 20 April 2000 (20.04.00)		
Applicant's or agent's file reference 1998/F116 PCT		
<b>IMPORTANT NOTICE</b>		
International application No. PCT/EP99/07084	International filing date (day/month/year) 23 September 1999 (23.09.99)	Priority date (day/month/year) 09 October 1998 (09.10.98)
Applicant AVENTIS RESEARCH & TECHNOLOGIES GMBH & CO. KG et al		

1. Notice is hereby given that the International Bureau has communicated, as provided in Article 20, the international application to the following designated Offices on the date indicated above as the date of mailing of this Notice:

CN,JP,US

In accordance with Rule 47.1(c), third sentence, those Offices will accept the present Notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

2. The following designated Offices have waived the requirement for such a communication at this time:

CA,EP

The communication will be made to those Offices only upon their request. Furthermore, those Offices do not require the applicant to furnish a copy of the international application (Rule 49.1(a-bis)).

3. Enclosed with this Notice is a copy of the international application as published by the International Bureau on

20 April 2000 (20.04.00) under No. WO 00/21971

**REMINDER REGARDING CHAPTER II (Article 31(2)(a) and Rule 54.2)**

If the applicant wishes to postpone entry into the national phase until 30 months (or later in some Offices) from the priority date, a demand for international preliminary examination must be filed with the competent International Preliminary Examining Authority before the expiration of 19 months from the priority date.

It is the applicant's sole responsibility to monitor the 19-month time limit.

Note that only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination.

**REMINDER REGARDING ENTRY INTO THE NATIONAL PHASE (Article 22 or 39(1))**

If the applicant wishes to proceed with the international application in the national phase, he must, within 20 months or 30 months, or later in some Offices, perform the acts referred to therein before each designated or elected Office.

For further important information on the time limits and acts to be performed for entering the national phase, see the Annex to Form PCT/IB/301 (Notification of Receipt of Record Copy) and Volume II of the PCT Applicant's Guide.

<p>The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland</p> <p>Facsimile No. (41-22) 740.14.35</p>	<p>Authorized officer J. Zahra</p> <p>Telephone No. (41-22) 338.83.38</p>
---	---

Continuation of Form PCT/IB/308

NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE COMMUNICATION OF  
THE INTERNATIONAL APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES

<b>Date of mailing (day/month/year)</b> 20 April 2000 (20.04.00)	<b>IMPORTANT NOTICE</b>
<b>Applicant's or agent's file reference</b> 1998/F116 PCT	<b>International application No.</b> PCT/EP99/07084
<p>The applicant is hereby notified that, at the time of establishment of this Notice, the time limit under Rule 46.1 for making amendments under Article 19 has not yet expired and the International Bureau had received neither such amendments nor a declaration that the applicant does not wish to make amendments.</p>	

**PCT**  
RECEIVING OFFICE REQUEST FORM  
198at29  
(4) pages  
ANTRAG

Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird.

Vom Anmeldeamt auszufüllen	
PCT/EP 99 / 07084	
Internationales Aktenzeichen	
23 SEP 1999	(23. 09. 1999)
Internationales Anmeldedatum	
EUROPEAN PATENT OFFICE PCT INTERNATIONAL APPLICATION Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"	
Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts (falls gewünscht) (max. 12 Zeichen) 1998/F116 PCT	

**Feld Nr. I BEZEICHNUNG DER ERFINDUNG**

Substituierte Isophosphindoline und ihre Verwendung

**Feld Nr. II ANMELDER**

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

Aventis Research & Technologies GmbH & Co KG

D-65926 Frankfurt am Main  
Deutschland

☐ Diese Person ist gleichzeitig Erfinder

Telefonnr.: 069-305-3335

Telefaxnr.: 069-305-16350

Fernschreibnr.:

Staatsangehörigkeit (Staat): DE

Sitz oder Wohnsitz (Staat): DE

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten:

☐ alle Bestimmungsstaaten

☒ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika

☐ nur die Vereinigten Staaten von Amerika

☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

**Feld Nr. III WEITERE ANMELDER UND/ODER (WEITERE) ERFINDER**

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)

HAACK, Karl-Josef  
Lenzhahner Weg 5  
65527 Niedernhausen  
Deutschland

Diese Person ist:

☐ nur Anmelder

☒ Anmelder und Erfinder

☐ nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)

Staatsangehörigkeit (Staat): DE

Sitz oder Wohnsitz (Staat): DE

Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten:

☐ alle Bestimmungsstaaten

☐ alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika

☒ nur die Vereinigten Staaten von Amerika

☐ die im Zusatzfeld angegebenen Staaten

☒ Weitere Anmelder und/oder (weitere) Erfinder sind auf einem Fortsetzungsblatt angegeben.

**Feld Nr. IV ANWALT ODER GEMEINSAMER VERTRETER; ODER ZUSTELLANSCHRIFT**

Die folgende Person wird hiermit bestellt/ist bestellt worden, um für den (die) Anmelder vor den zuständigen internationalen Behörden in folgender Eigenschaft zu handeln als:

☐ Anwalt

☐ gemeinsamer Vertreter

Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben.)

Aventis Research & Technologies GmbH & Co KG  
Patent- und Lizenzabteilung  
Industriepark Höchst, Gebäude K 801  
D-65926 Frankfurt am Main / DE

Telefonnr.: 069-305-3335

Telefaxnr.: 069-305-16350

Fernschreibnr.:

☒ Zustellanschrift: Dieses Kästchen ist anzukreuzen, wenn kein Anwalt oder gemeinsamer Vertreter bestellt ist und statt dessen im obigen Feld eine spezielle Zustellanschrift angegeben ist.

Fortsetzung von Feld Nr. III WEITERE ANMELDER UND/ODER (WEITERE) ERFINDER	
<i>Wird keines der folgenden Felder benutzt, so sollte dieses Blatt dem Antrag nicht beigelegt werden.</i>	
<p><small>Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)</small></p> <p><b>RIERMEIER, Thomas</b>  <b>Klosterhofstr. 114</b>  <b>65931 Frankfurt</b>  <b>Deutschland</b></p>	<p>Diese Person ist:</p> <p><input type="checkbox"/> nur Anmelder</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Anmelder und Erfinder</p> <p><input type="checkbox"/> nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)</p>
Staatsangehörigkeit (Staat): <b>DE</b>	Sitz oder Wohnsitz (Staat): <b>DE</b>
<p>Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten: <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika <input checked="" type="checkbox"/> nur die Vereinigten Staaten von Amerika <input type="checkbox"/> die im Zusatzfeld angegebenen Staaten</p>	
<p><small>Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)</small></p> <p><b>ZAPF, Alexander</b>  <b>Anton-Bruckner-Straße 15</b>  <b>83024 Rosenheim</b>  <b>Deutschland</b></p>	<p>Diese Person ist:</p> <p><input type="checkbox"/> nur Anmelder</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Anmelder und Erfinder</p> <p><input type="checkbox"/> nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)</p>
Staatsangehörigkeit (Staat): <b>DE</b>	Sitz oder Wohnsitz (Staat): <b>DE</b>
<p>Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten: <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika <input checked="" type="checkbox"/> nur die Vereinigten Staaten von Amerika <input type="checkbox"/> die im Zusatzfeld angegebenen Staaten</p>	
<p><small>Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)</small></p> <p><b>BELLER, Matthias</b>  <b>Bernsteinweg 16</b>  <b>18119 Rostock</b>  <b>Deutschland</b></p>	<p>Diese Person ist:</p> <p><input type="checkbox"/> nur Anmelder</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Anmelder und Erfinder</p> <p><input type="checkbox"/> nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)</p>
Staatsangehörigkeit (Staat): <b>DE</b>	Sitz oder Wohnsitz (Staat): <b>DE</b>
<p>Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten: <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika <input checked="" type="checkbox"/> nur die Vereinigten Staaten von Amerika <input type="checkbox"/> die im Zusatzfeld angegebenen Staaten</p>	
<p><small>Name und Anschrift: (Familienname, Vorname; bei juristischen Personen vollständige amtliche Bezeichnung. Bei der Anschrift sind die Postleitzahl und der Name des Staats anzugeben. Der in diesem Feld in der Anschrift angegebene Staat ist der Staat des Sitzes oder Wohnsitzes des Anmelders, sofern nachstehend kein Staat des Sitzes oder Wohnsitzes angegeben ist.)</small></p> <p><b>BOSCH, Boris E.</b>  <b>Leipziger Str. 37</b>  <b>60487 Frankfurt</b>  <b>Deutschland</b></p>	<p>Diese Person ist:</p> <p><input type="checkbox"/> nur Anmelder</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Anmelder und Erfinder</p> <p><input type="checkbox"/> nur Erfinder (Wird dieses Kästchen angekreuzt, so sind die nachstehenden Angaben nicht nötig.)</p>
Staatsangehörigkeit (Staat): <b>DE</b>	Sitz oder Wohnsitz (Staat): <b>DE</b>
<p>Diese Person ist Anmelder für folgende Staaten: <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten <input type="checkbox"/> alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme der Vereinigten Staaten von Amerika <input checked="" type="checkbox"/> nur die Vereinigten Staaten von Amerika <input type="checkbox"/> die im Zusatzfeld angegebenen Staaten</p>	

**Feld Nr. V BESTIMMUNG VON STAATEN**

Die folgenden Bestimmungen nach Regel 4.9 Absatz a werden hiermit vorgenommen (bitte die entsprechenden Kästchen ankreuzen; wenigstens ein Kästchen muß angekreuzt werden):

**Regionales Patent**


- ☐ **AP ARIPO-Patent:** GH Ghana, GM Gambia, KE Kenia, LS Lesotho, MW Malawi, SD Sudan, SZ Swasiland, UG Uganda, ZW Simbabwe und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Harare-Protokolls und des PCT ist
- ☐ **EA Eurasisches Patent:** AM Armenien, AZ Aserbaidshan, BY Belarus, KG Kirgisistan, KZ Kasachstan, MD Republik Moldau, RU Russische Föderation, TJ Tadschikistan, TM Turkmenistan und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Eurasischen Patentübereinkommens und des PCT ist
- ☒ **EP Europäisches Patent:** AT Österreich, BE Belgien, CH und LI Schweiz und Liechtenstein, CY Zypern, DE Deutschland, DK Dänemark, ES Spanien, FI Finnland, FR Frankreich, GB Vereinigtes Königreich, GR Griechenland, IE Irland, IT Italien, LU Luxemburg, MC Monaco, NL Niederlande, PT Portugal, SE Schweden und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und des PCT ist
- ☐ **OA OAPI-Patent:** BF Burkina Faso, BJ Benin, CF Zentralafrikanische Republik, CG Kongo, CI Côte d'Ivoire, CM Kamerun, GA Gabun, GN Guinea, GW Guinea-Bissau, ML Mali, MR Mauretanien, NE Niger, SN Senegal, TD Tschad, TG Togo und jeder weitere Staat, der Vertragsstaat der OAPI und des PCT ist (falls eine andere Schutzrechtsart oder ein sonstiges Verfahren gewünscht wird, bitte auf der gepunkteten Linie angeben) .....

**Nationales Patent (falls eine andere Schutzrechtsart oder ein sonstiges Verfahren gewünscht wird, bitte auf der gepunkteten Linie angeben):**

- |   |   |
|---|---|
| <input type="checkbox"/> AL Albanien .....                          | <input type="checkbox"/> LS Lesotho .....   |
| <input type="checkbox"/> AM Armenien .....                          | <input type="checkbox"/> LT Litauen .....   |
| <input type="checkbox"/> AT Österreich .....                        | <input type="checkbox"/> LU Luxemburg .....                                       |
| <input type="checkbox"/> AU Australien .....                        | <input type="checkbox"/> LV Lettland .....  |
| <input type="checkbox"/> AZ Aserbaidshan .....                      | <input type="checkbox"/> MD Republik Moldau .....                                 |
| <input type="checkbox"/> BA Bosnien-Herzegowina .....               | <input type="checkbox"/> MG Madagaskar .....                                      |
| <input type="checkbox"/> BB Barbados .....                          | <input type="checkbox"/> MK Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien ..... |
| <input type="checkbox"/> BG Bulgarien .....                         | <input type="checkbox"/> MN Mongolei .....  |
| <input type="checkbox"/> BR Brasilien .....                         | <input type="checkbox"/> MW Malawi .....  |
| <input type="checkbox"/> BY Belarus .....                           | <input type="checkbox"/> MX Mexiko .....  |
| <input checked="" type="checkbox"/> CA Kanada .....                 | <input type="checkbox"/> NO Norwegen .....  |
| <input type="checkbox"/> CH und LI Schweiz und Liechtenstein .....  | <input type="checkbox"/> NZ Neuseeland .....                                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> CN China .....                  | <input type="checkbox"/> PL Polen .....   |
| <input type="checkbox"/> CU Kuba .....                              | <input type="checkbox"/> PT Portugal .....  |
| <input type="checkbox"/> CZ Tschechische Republik .....             | <input type="checkbox"/> RO Rumänien .....  |
| <input type="checkbox"/> DE Deutschland .....                       | <input type="checkbox"/> RU Russische Föderation .....                            |
| <input type="checkbox"/> DK Dänemark .....                          | <input type="checkbox"/> SD Sudan .....   |
| <input type="checkbox"/> EE Estland .....                           | <input type="checkbox"/> SE Schweden .....  |
| <input type="checkbox"/> ES Spanien .....                           | <input type="checkbox"/> SG Singapur .....  |
| <input type="checkbox"/> FI Finnland .....                          | <input type="checkbox"/> SI Slowenien .....                                       |
| <input type="checkbox"/> GB Vereinigtes Königreich .....            | <input type="checkbox"/> SK Slowakei .....  |
| <input type="checkbox"/> GD Grenada .....                           | <input type="checkbox"/> SL Sierra Leone .....                                    |
| <input type="checkbox"/> GE Georgien .....                          | <input type="checkbox"/> TJ Tadschikistan .....                                   |
| <input type="checkbox"/> GH Ghana .....                             | <input type="checkbox"/> TM Turkmenistan .....                                    |
| <input type="checkbox"/> GM Gambia .....                            | <input type="checkbox"/> TR Türkei .....  |
| <input type="checkbox"/> HR Kroatien .....                          | <input type="checkbox"/> TT Trinidad und Tobago .....                             |
| <input type="checkbox"/> HU Ungarn .....                            | <input type="checkbox"/> UA Ukraine .....   |
| <input type="checkbox"/> ID Indonesien .....                        | <input type="checkbox"/> UG Uganda .....  |
| <input type="checkbox"/> IL Israel .....                            | <input checked="" type="checkbox"/> US Vereinigte Staaten von Amerika .....       |
| <input type="checkbox"/> IN Indien .....                            | .....   |
| <input type="checkbox"/> IS Island .....                            | <input type="checkbox"/> UZ Usbekistan .....                                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> JP Japan .....                  | <input type="checkbox"/> VN Vietnam .....   |
| <input type="checkbox"/> KE Kenia .....                             | <input type="checkbox"/> YU Jugoslawien .....                                     |
| <input type="checkbox"/> KG Kirgisistan .....                       | <input type="checkbox"/> ZW Simbabwe .....  |
| <input type="checkbox"/> KP Demokratische Volksrepublik Korea ..... | .....   |
| <input type="checkbox"/> KR Republik Korea .....                    | <input type="checkbox"/> AE Vereinigte arabische Emirat .....                     |
| <input type="checkbox"/> KZ Kasachstan .....                        | <input type="checkbox"/> ZA Südafrika .....                                       |
| <input type="checkbox"/> LC Saint Lucia .....                       | .....   |
| <input type="checkbox"/> LK Sri Lanka .....                         |   |
| <input type="checkbox"/> LR Liberia .....                           |   |

Kästchen für die Bestimmung von Staaten (für die Zwecke eines nationalen Patents), die dem PCT nach der Veröffentlichung dieses Formblatts beigetreten sind:

**Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen:** Zusätzlich zu den oben genannten Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.9 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der im Zusatzfeld genannten Bestimmungen, die von dieser Erklärung ausgenommen sind. Der Anmelder erklärt, daß diese zusätzlichen Bestimmungen unter dem Vorbehalt einer Bestätigung stehen und jede zusätzliche Bestimmung, die vor Ablauf von 15 Monaten ab dem Prioritätsdatum nicht bestätigt wurde, nach Ablauf dieser Frist als vom Anmelder zurückgenommen gilt. (Die Bestätigung einer Bestimmung erfolgt durch die Einreichung einer Mitteilung, in der diese Bestimmung angegeben wird, und die Zahlung der Bestimmungs- und der Bestätigungsgebühr. Die Bestätigung muß beim Anmeldeamt innerhalb der Frist von 15 Monaten eingehen.)

<b>Feld Nr. VI PRIORITÄTSANSPRUCH</b>		<input type="checkbox"/> Weitere Prioritätsansprüche sind im Zusatzfeld angegeben.		
Anmeldedatum der früheren Anmeldung (Tag/Monat)	Aktenzeichen der früheren Anmeldung	Ist die frühere Anmeldung eine:		
		national Anmeldung: Staat	regionale Anmeldung:* regionales Amt	internationale Anmeldung: Anmeldeamt
Zeile (1) 09. Oktober 1998 (09.10.98)	19846559.9	DE		
Zeile (2)				
Zeile (3)				
<input type="checkbox"/> Das Anmeldeamt wird ersucht, eine beglaubigte Abschrift der oben in der (den) Zeile(n) bezeichneten früheren Anmeldung(en) zu erstellen und dem internationalen Büro zu übermitteln (nur falls die frühere Anmeldung(en) bei dem Amt eingereicht worden ist(sind), das für die Zwecke dieser internationalen Anmeldung Anmeldeamt ist) * Falls es sich bei der früheren Anmeldung um eine ARIPO-Anmeldung handelt, so muß in dem Zusatzfeld mindestens ein Staat angegeben werden, der Mitgliedstaat der Pariser Verbandsübereinkunft zum Schutz des gewerblichen Eigentums ist und für den die frühere Anmeldung eingereicht wurde.				
<b>Feld Nr. VII INTERNATIONALE RECHERCHENBEHÖRDE</b>				
Wahl der internationalen Recherchenbehörde (ISA) (falls zwei oder mehr als zwei internationale Recherchenbehörden für die Ausführung der internationalen Recherche zuständig sind, geben Sie die von Ihnen gewählte Behörde an; der Zweibuchstaben-Code kann benutzt werden)		Antrag auf Nutzung der Ergebnisse einer früheren Recherche; Bezugnahme auf diese frühere Recherche (falls eine frühere Recherche bei der internationalen Recherchenbehörde beantragt oder von ihr durchgeführt worden ist):		
ISA /		Datum (Tag/Monat/Jahr)	Aktenzeichen	Staat (oder regionales Amt)
<b>Feld Nr. VIII KONTROLLISTE; EINREICHUNGSSPRACHE</b>				
Diese internationale Anmeldung enthält die folgende Anzahl von Blättern:		Dieser internationalen Anmeldung liegen die nachstehend angekreuzten Unterlagen bei:		
Antrag : 3 <sup>AA</sup> 4 <sup>A</sup>		1. <input checked="" type="checkbox"/> Blatt für die Gebührenberechnung		
Beschreibung (ohne Sequenzprotokollteil) : 16		2. <input type="checkbox"/> Gesonderte unterzeichnete Vollmacht		
Ansprüche : 3		3. <input checked="" type="checkbox"/> Kopie der allgemeinen Vollmacht; Aktenzeichen (falls vorhanden):		
Zusammenfassung : 1		4. <input type="checkbox"/> Begründung für das Fehlen einer Unterschrift		
Zeichnungen :		5. <input type="checkbox"/> Prioritätsbeleg(e), in Feld Nr. VI durch folgende Zeilennummer gekennzeichnet:		
Sequenzprotokollteil der Beschreibung :		6. <input type="checkbox"/> Übersetzung der internationalen Anmeldung in die folgende Sprache:		
Blattzahl insgesamt : 23 <sup>AA</sup> 24 <sup>A</sup>		7. <input type="checkbox"/> Gesonderte Angaben zu hinterlegten Mikroorganismen oder anderem biologischen Material		
Abbildung der Zeichnungen, die mit der Zusammenfassung veröffentlicht werden soll (Nr.):		8. <input type="checkbox"/> Sequenzprotokolle für Nucleotide und/oder Aminosäuren in computerlesbarer Form		
		9. <input type="checkbox"/> Sonstige (einzeln auflisten):		
		Abbildung der Zeichnungen, die mit der Zusammenfassung veröffentlicht werden soll (Nr.):		
		Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht wird: DE		
<b>Feld Nr. IX UNTERSCHRIFT DES ANMELDERS ODER DES ANWALTS</b>				
Der Name jeder unterzeichnenden Person ist neben der Unterschrift zu wiederholen, und es ist anzugeben, sofern sich dies nicht eindeutig aus dem Antrag ergibt, in welcher Eigenschaft die Person unterzeichnet.				
 Dr. Klaus Dörr (AV-Nr. 37986)				

Vom Anmeldeamt auszufüllen	
1. Datum des tatsächlichen Eingangs dieser internationalen Anmeldung: 23 SEP 1999 (23.09.99)	2. Zeichnungen <input type="checkbox"/> eingegangen:  <input type="checkbox"/> nicht eingegangen:
3. Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingegangener Unterlagen oder Zeichnungen zur Vervollständigung dieser internationalen Anmeldung:	
4. Datum des fristgerechten Eingangs der angeforderten Richtigstellungen nach Artikel 11(2) PCT:	
5. Internationale Recherchenbehörde (falls zwei oder mehr zuständig sind): ISA /	6. <input type="checkbox"/> Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchegebühr aufgeschoben

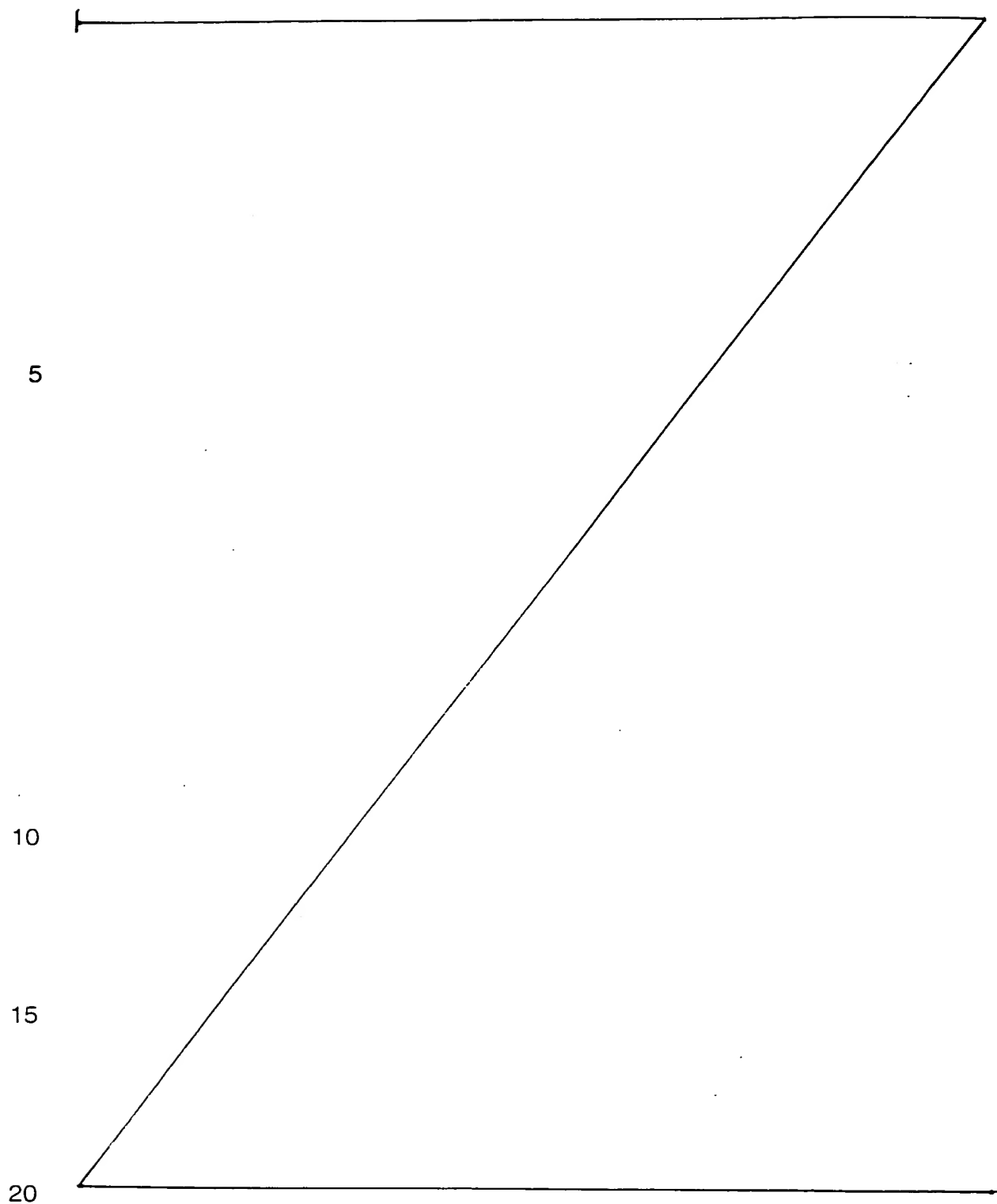
Vom Internationalen Büro auszufüllen
Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro:



November 16, 2000

3

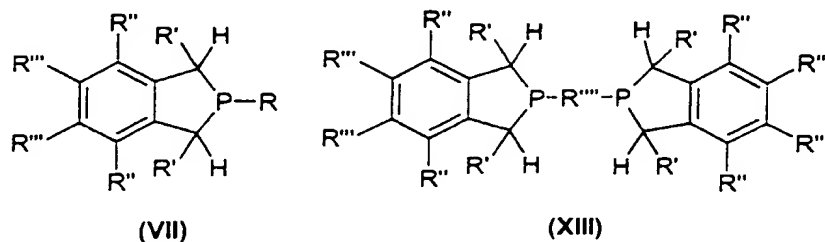
09/807122  
JC08 Rec'd PCT/PTO 06 APR 2001  
EP 009907084



phospholine ligands but also  
be varied electronically within a wide range.

AMENDED SHEET

This object is achieved by the provision of substituted isophosphindolines of the formula (VII) or (XIII),



5

where, in the formula (VII),

R is hydrogen or an alkyl, aryl, haloaryl or haloalkyl group,

R' are alkyl, aryl, haloaryl or haloalkyl groups,

10 R'' and R''' are each, independently of one another, hydrogen, alkyl, aryl, haloalkyl or haloaryl, alkoxy, amino, dialkylamino or sulfonate groups or fluorine and two adjacent radicals R''/R'', R''/R''' or R'''/R''' may also be bridged,

15

and, in the formula (XIII)

R' are alkyl, aryl, haloaryl or haloalkyl groups,

20 R'' and R''' are each, independently of one another, hydrogen, alkyl, aryl, haloalkyl or haloaryl, alkoxy, amino, dialkylamino or sulfonate groups or fluorine and two adjacent radicals R''/R'', R''/R''' or R'''/R''' may also be bridged, and

25 R'''' is an alkanediyl, arenediyl or heteroarenediyl group.

25

For the present purposes, alkyl and haloalkyl groups include the corresponding cyclo compounds. Particular preference is given to chiral substituted isophosphindolines.

30 The substituted isophosphindoline of the invention preferably bears alkyl, aryl, haloaryl, haloalkyl, alkoxy or/and dialkylamino groups which are

selected independently of one another and each contain from 1 to 20, in particular from 1 to 6, carbon atoms.

5 The haloalkyl or/and haloaryl groups preferably have the formulae  $\text{CHal}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CHal}_3$ ,  $\text{C}_2\text{Hal}_5$ , where Hal can be, in particular, F, Cl or Br. Particular preference is given to haloalkyl or/and haloaryl groups of the formulae  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{C}_2\text{F}_5$ .

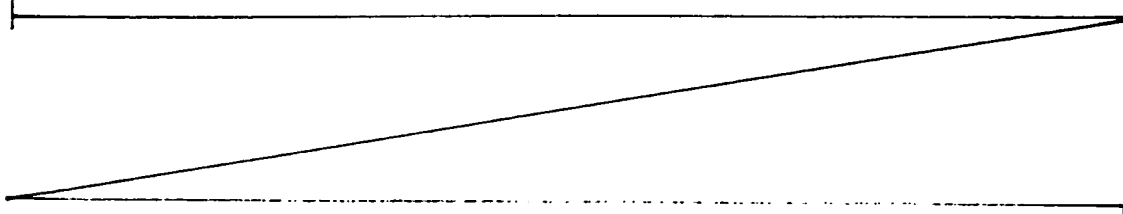
10 It is also preferred that the alkanediyl, arenediyl or heteroarenediyl group  $\text{R}'''$  of the substituted isophosphindoline has from 2 to 20 carbon atoms, more preferably 2, 3, 4, 5 or 6 carbon atoms, in particular 2 or 6 carbon atoms. Ethane-1,2-diyl, benzene-1,2-diyl or furan-3,4-diyl are particularly preferred examples of alkanediyl, arenediyl or heteroarenediyl groups  $\text{R}'''$ .

15 Furthermore, preference is given to a substituted isophosphindoline in which R is phenyl,  $\text{R}'$  is methyl or ethyl,  $\text{R}''$  and  $\text{R}'''$  is hydrogen, methyl or/and phenylene,  $\text{R}'''$  is benzene-1,2-diyl. Particular preference is given to a substituted isophosphindoline in which R is phenyl,  $\text{R}'$  is methyl or ethyl,  $\text{R}''$  and  $\text{R}'''$  are hydrogen, methyl or/and phenylene,  $\text{R}'''$  is benzene-1,2-diyl,  
20 in which  $\text{R}''$  and  $\text{R}'''$  are not hydrogen or in which either  $\text{R}''$  or  $\text{R}'''$  is hydrogen.

Furthermore, preference is given to substituted isophosphindolines whose asymmetric centers in the 1 and 3 positions have the same absolute  
25 configuration. The substituted isophosphindoline of the formula (VII) has two asymmetric centers having the same absolute configuration in positions 1 and 3, while in the case of those of the formula (XIII), each has two or four asymmetric centers having the same absolute configuration in the positions 1, 1', 3 and 3'.

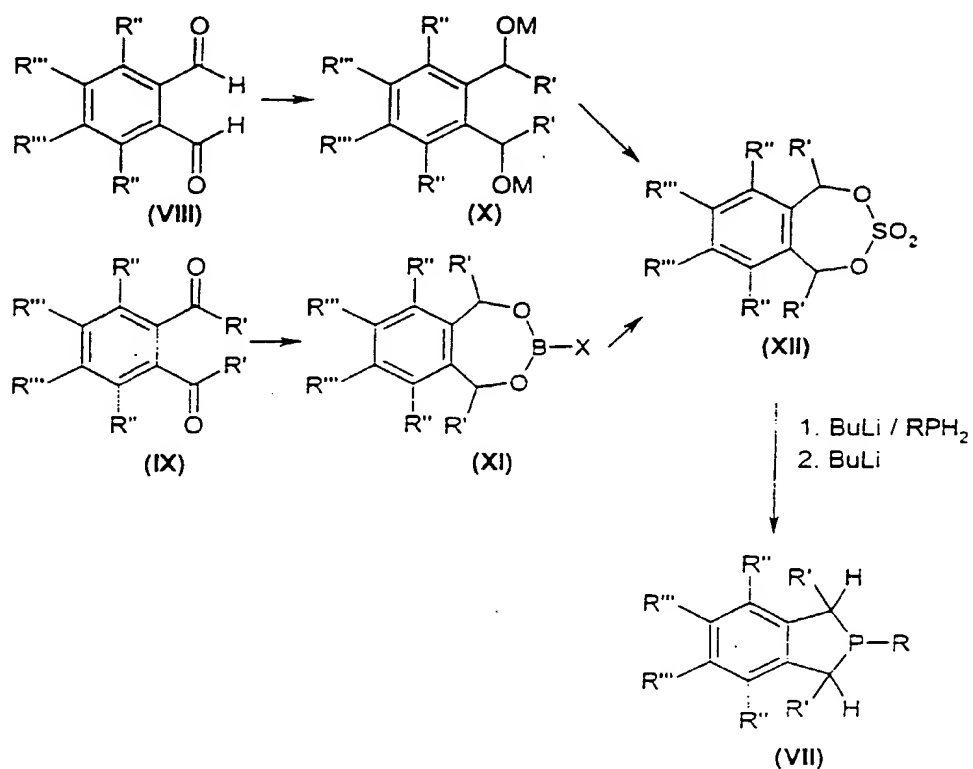
30

Finally, preference is given to substituted chiral isophosphindolines which are enriched in one enantiomer.



5

10

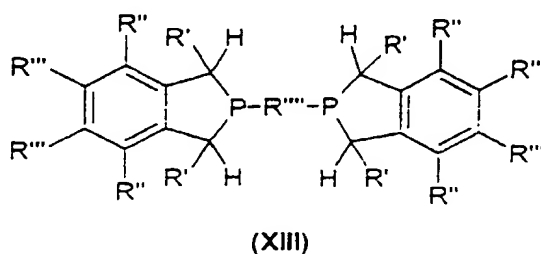


15 In a modification of known processes (Burk US 5,386,061), reaction of the sulfate of the formula (XII) with phosphines of the formula RPH<sub>2</sub> (R = alkyl, aryl, heteroarenyl) gives, via the corresponding phosphides, the corresponding substituted isophosphindoline.

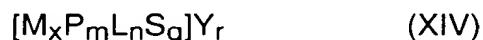
20 It is likewise possible to convert the isomer mixture of the sulfate of the formula (XII) into the corresponding mixture of isomeric isophosphindolines

and then to carry out a separation in order to obtain stereochemically pure substituted isophosphindolines. This separation can be achieved, for example, by fractional crystallization and/or chromatographically.

- 5 As phosphines of the formula  $RPH_2$ , it is possible to use all types of arylphosphines and alkylphosphines as starting materials ( $R = \text{aryl, alkyl}$ ). If, instead of these, diphosphines of the formula  $H_2P=R'''-PH_2$  are used, the products are chelating ligands of the formula (XIII) which in the case of  $c_2$ -symmetric sulfates of the formula (XII) lead to chiral and then likewise
- 10  $c_2$ -symmetric chelating ligands.



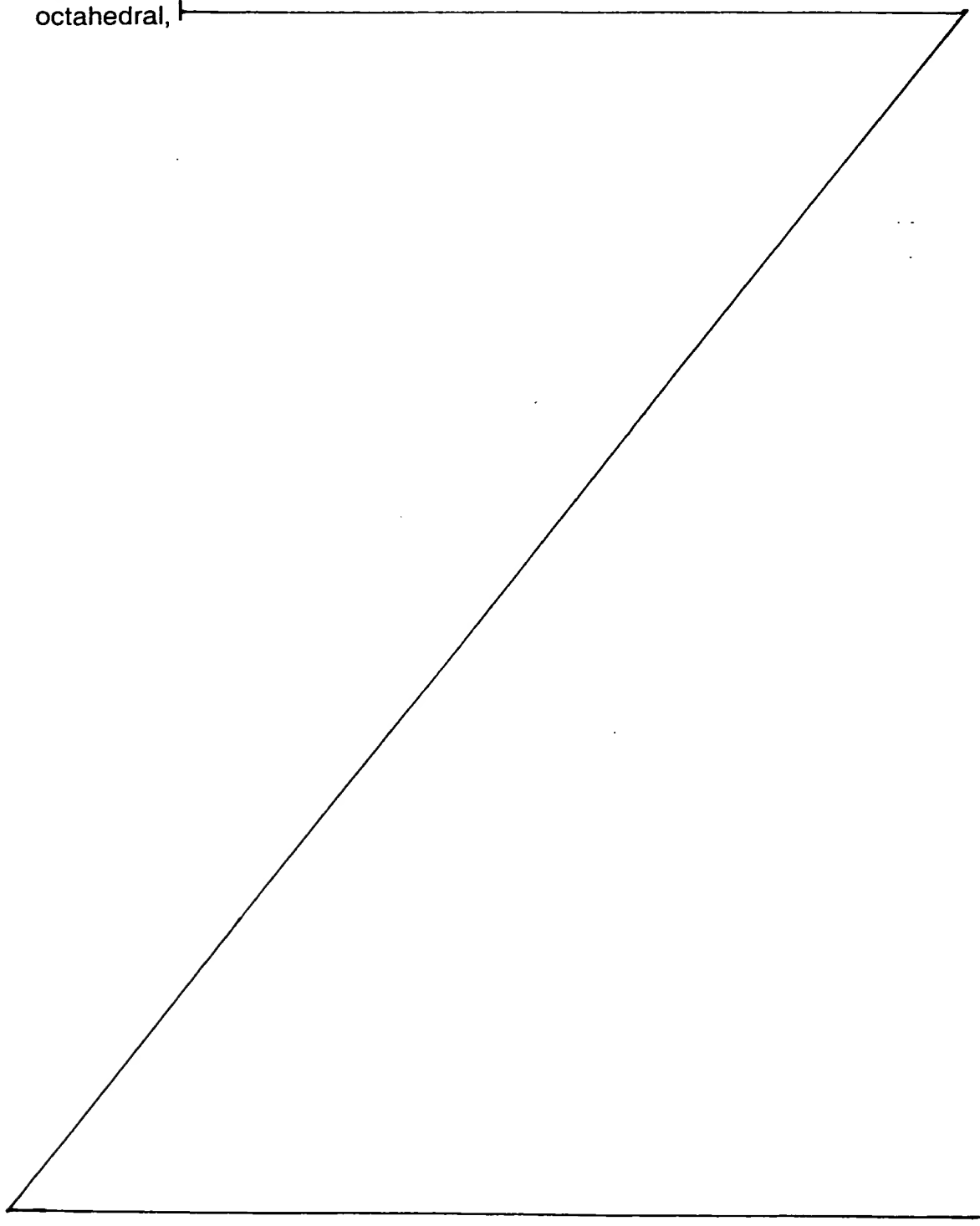
- The compounds of the formulae (VII) and (XIII) can be used as ligands on
- 15 metals in asymmetric, metal-catalyzed reactions (e.g. asymmetric hydrogenation, transfer hydrogenations, asymmetric rearrangement, asymmetric cyclopropanation or Heck reactions) and in polymerizations. They are particularly useful for asymmetric reactions.
- 20 The ligands of the formulae (VII) and (XIII) form complexes of the type (XIV),



- 25 where, in the formula (XIV), M is a metal center, preferably a transition metal center, L are identical or different coordinating organic or inorganic ligands and P are organic ligands, according to the invention isophosphindolines of the type (VII) or (XIII), S are coordinating solvent molecules and Y are equivalents of noncoordinating anions, where x and m
- 30 are integers greater than or equal to 1, n, q and r are integers greater than or equal to 0.

The maximum value of the sum  $m + n + q$  is determined by the number of coordination sites available on the metal centers, but not all coordination sites have to be occupied. Preference is given to complexes having an octahedral,

5



AMENDED SHEET

## Claims:

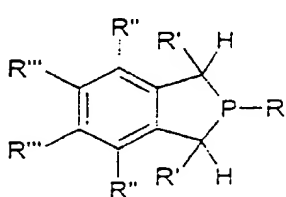
1. A complex of the formula (XIV)



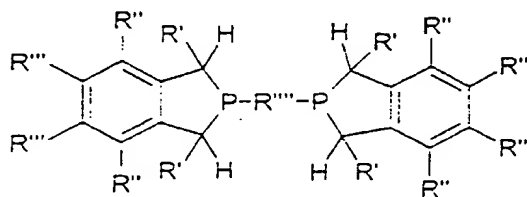
where

- M is a metal center,  
 P are organic ligands,  
 10 L are identical or different organic or inorganic ligands,  
 S are coordinating solvent molecules and  
 Y are noncoordinating anionic equivalents

and x and m are integers greater than or equal to 1, n, q and r are  
 15 integers greater than or equal to 0, in which one or more identical or  
 different isophosphindolines of the type (VII) or (XIII)



(VII)



(XIII)

20 where, in the formula (VII),

- R is hydrogen or an alkyl, aryl, haloaryl or haloalkyl group,  
 R' are alkyl, aryl, haloaryl or haloalkyl groups,  
 25 R'' and R''' are each, independently of one another, hydrogen, alkyl, aryl, haloalkyl or haloaryl, alkoxy, amino, dialkylamino or sulfonate groups or fluorine and two adjacent radicals R''/R'', R''/R''' or R'''/R''' may also be bridged,

and, in the formula (XIII)

- 30 R' are alkyl, aryl, haloaryl or haloalkyl groups,

5 R" and R''' are each, independently of one another, hydrogen, alkyl, aryl, haloalkyl or haloaryl, alkoxy, amino, dialkylamino or sulfonate groups or fluorine and two adjacent radicals R"/R", R"/R''' or R'''/R''' may also be bridged, and

R''' is an alkanediyl, arenediyl or heteroarenediyl group, where the term alkyl or haloalkyl group encompasses the corresponding cyclo compounds, are present as ligands P.

10

2. A complex as claimed in claim 1, wherein the sum  $m + n + q$  is less than or equal to  $6x$ .

15

3. A complex as claimed in claim 1 or 2 in which less than four metal centers, preferably one or two metal centers, are present.

20

4. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein the metal center or centers  $M_x$  comprise at least one transition metal, in particular palladium, platinum, rhodium, ruthenium, osmium, iridium, cobalt, nickel or/and copper.

25

5. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein the alkyl, aryl, haloalkyl, haloalkyl, alkoxy or/and dialkylamino groups each have, independently of one another, from 1 to 20, preferably from 1 to 6, carbon atoms.

6. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein the haloalkyl or/and haloaryl groups are  $CF_3$ ,  $CH_2CF_3$ ,  $C_2F_5$ .

30

7. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein the alkanediyl, arenediyl or heteroarenediyl group R''' has from 2 to 20 carbon atoms, preferably 2, 3, 4, 5 or 6 carbon atoms, in particular 2 or 6 carbon atoms.

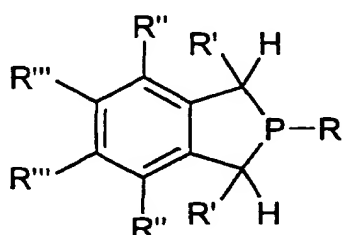


8. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein the alkanediyl, arenediyl or heteroarenediyl group R<sup>'''</sup> is ethane-1,2-diyl, benzene-1,2-diyl or furan-3,4-diyl.
- 5 9. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein R is phenyl, R' is methyl or ethyl, R'' and R''' are hydrogen, methyl or/and phenylene, R<sup>'''</sup> is benzene-1,2-diyl.
- 10 10. A complex as claimed in any of the preceding claims in which chiral ligands P are present.
- 15 11. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein a ligand P is an isophosphindoline of the formula (VII) which has two asymmetric centers having the same absolute configuration in positions 1 and 3.
- 20 12. A complex as claimed in any of claims 1 to 11, wherein a ligand P is an isophosphindoline of the formula (XIII) which has three or four asymmetric centers having the same absolute configuration in positions 1, 1', 3 and 3'.
- 25 13. A complex as claimed in any of the preceding claims, wherein R is phenyl, R' is methyl, R'' and R''' are hydrogen and R<sup>'''</sup> is benzene-1,2-diyl.
- 30 14. A complex as claimed in any of the preceding claims which is enriched in one enantiomer.
15. The use of a complex as claimed in any of claims 1 to 15 as catalyst for asymmetric reactions or polymerizations, in particular for asymmetric hydrogenations, transfer hydrogenations, rearrangements, cyclopropanations, Heck reactions.

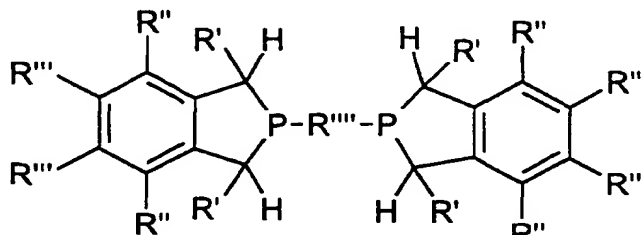
Phospholanliganden analog, aber darüber hinaus elektronisch in breitem Rahmen  
variierbar ist.

Diese Aufgabe wird mit der Bereitstellung von substituierten Isophosphindolinen  
gemäß Formel (VII) oder (XIII) gelöst,

5



(VII)



(XIII)

wobei in der allgemeinen Formel (VII)

R Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

10 R' Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander Wasserstoff, Alkyl-, Aryl, Haloalkyl- oder  
Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor  
bedeuten

und wobei zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt  
sein können

15

oder wobei in der allgemeinen Formel (XIII)

R' Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloalkyl- oder  
Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor  
bedeuten

und zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt sein  
können und

R''' eine Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe ist.

25

Der Begriff Alkyl- bzw. Haloalkylgruppe soll dabei die entsprechenden  
Cycloverbindungen einschließen. Bevorzugt sind insbesondere chirale substituierte  
Isophosphindoline.

Vorzugsweise weist das erfindungsgemäße substituierte Isophosphindolin Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkyl-, Alkoxy- oder/und Dialkylaminogruppen unabhängig voneinander auf, die jeweils 1 bis 20, insbesondere 1 bis 6 Kohlenstoffatome, enthalten.

5

Die Haloalkyl- oder/und Haloarylgruppen weisen vorzugsweise die allgemeinen Formeln  $\text{CHal}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CHal}_3$ ,  $\text{C}_2\text{Hal}_5$  auf, wobei Hal insbesondere für F, Cl und Br stehen kann. Besonders bevorzugt sind Haloalkyl- oder/und Haloarylgruppen der Formeln  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{C}_2\text{F}_5$ .

10

Weiterhin ist bevorzugt, daß die Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe  $\text{R}''''$  des substituierten Isophosphindolins 2 bis 20 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 2, 3, 4, 5 oder 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 2 oder 6 Kohlenstoffatome, aufweist. Ethan-1,2-diyl, Benzo-1,2-diyl oder Furan-3,4-diyl sind besonders bevorzugte Gruppen der Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe  $\text{R}''''$ .

15

Ferner ist ein substituiertes Isophosphindolin bevorzugt, bei dem R Phenyl,  $\text{R}'$  Methyl oder Ethyl,  $\text{R}''$  und  $\text{R}'''$  Wasserstoff, Methyl oder/und Phenylen,  $\text{R}''''$  Benzo-1,2-diyl ist. Besonders bevorzugt ist ein substituiertes Isophosphindolin, bei dem R Phenyl,  $\text{R}'$  Methyl oder Ethyl,  $\text{R}''$  und  $\text{R}'''$  Wasserstoff, Methyl oder/und Phenylen,  $\text{R}''''$  Benzo-1,2-diyl ist, bei dem  $\text{R}''$  und  $\text{R}'''$  nicht Wasserstoff ist oder bei dem entweder  $\text{R}''$  oder  $\text{R}'''$  Wasserstoff ist.

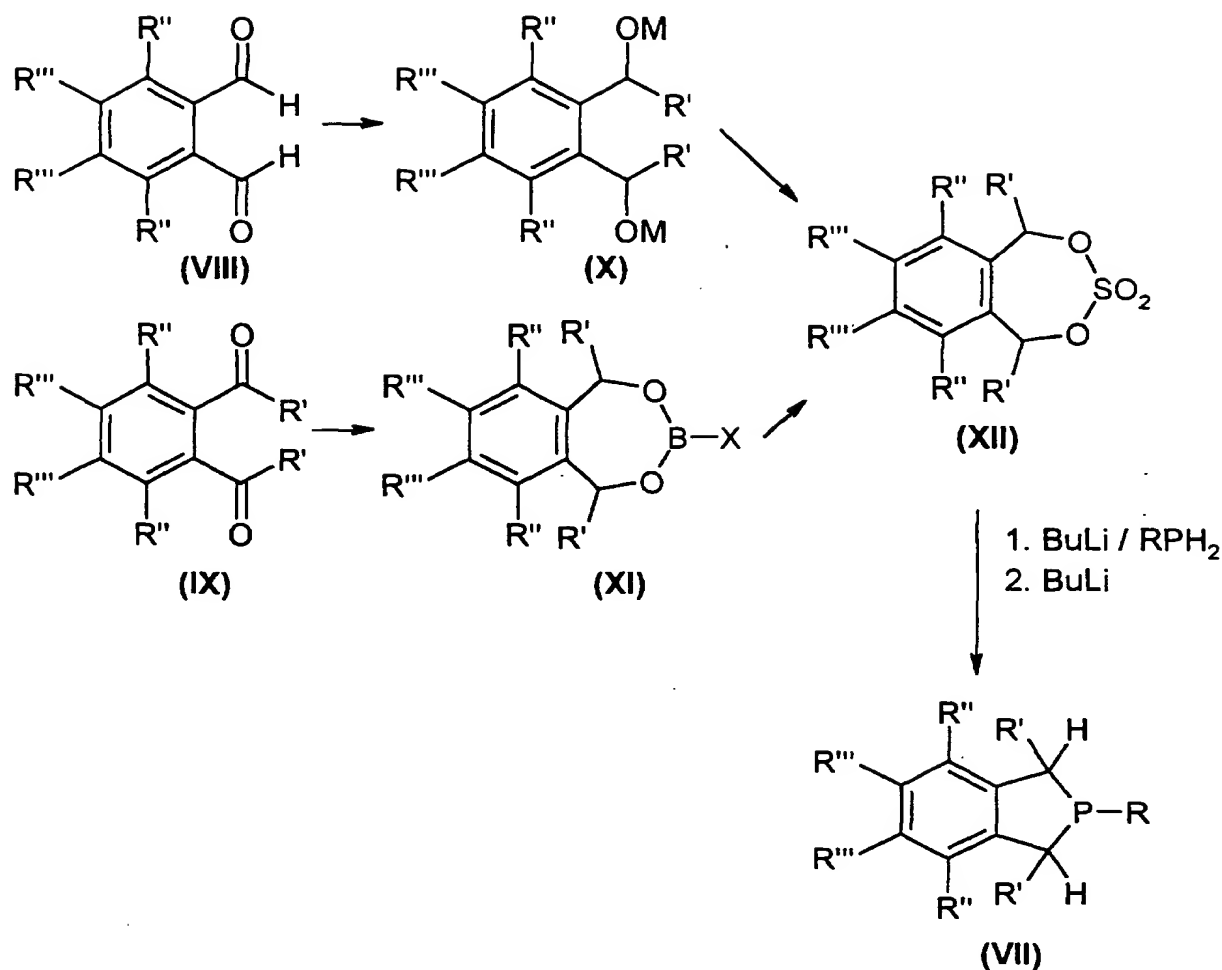
20

Weiterhin sind substituierte Isophosphindoline bevorzugt, die stereogene Zentren in 1- und 3-Position mit gleichen absoluten Konfigurationen. Bei substituiertem Isophosphindolin gemäß Formel (VII) weist dieses zwei stereogene Zentren in den Positionen 1 und 3 mit gleichen absoluten Konfigurationen auf, bei solchen gemäß Formel (XIII) weist jenes drei oder vier stereogene Zentren in den Positionen 1, 1', 3 und 3' mit gleichen absoluten Konfigurationen auf.

25

30

Schließlich sind substituierte chirale Isophosphindole bevorzugt, bei denen ein Enantiomer angereichert ist.

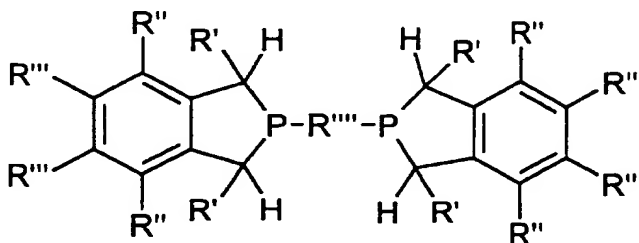


Die Umsetzung des Sulfats der allgemeinen Formel (XII) mit Phosphanen der allgemeinen Formel RPH<sub>2</sub> (R = Alkyl, Aryl, Heteroarendiyl) liefert in Abwandlung von bekannten Verfahren (Burk US 5,386,061) über die entsprechenden Phosphide das entsprechende substituierte Isophosphindolin.

Es ist ebenso möglich, das Sulfat der allgemeinen Formel (XII) als Isomerengemisch zum entsprechenden Gemisch isomerer Isophosphindoline umzusetzen und im Anschluß daran eine Trennung durchzuführen, um stereochemisch reine substituierte Isophosphindoline zu erhalten. Diese Trennung läßt sich beispielsweise durch fraktionierte Kristallisation und/oder chromatographisch erreichen.

Als Phosphate der allgemeinen Formel RPH<sub>2</sub> sind alle Arten von Aryl- und Alkylphosphanen als Ausgangssubstanzen einsetzbar (R = Aryl, Alkyl). Falls stattdessen Diphosphate der allgemeinen Formel H<sub>2</sub>P- R'''-PH<sub>2</sub> verwendet werden,

so entstehen Chelatliganden der allgemeinen Formel (XIII), die im Falle von  $c_2$ -symmetrischen Sulfaten der allgemeinen Formel (XII) zu chiralen und dann ebenfalls  $c_2$ -symmetrischen Chelatliganden führen.



(XIII)

5

Die Verbindungen der allgemeinen Formeln (VII) und (XIII) können als Liganden an Metallen in asymmetrischen, Metall-katalysierten Reaktionen (wie z. B. der asymmetrischen Hydrierung, der Transfer-Hydrierungen, der asymmetrischen Umlagerung, der asymmetrischen Cyclopropanierung oder Heck-Reaktionen) sowie bei Polymerisationen eingesetzt werden. Sie sind insbesondere für asymmetrische Reaktionen gut geeignet.

10

Die Liganden der allgemeinen Formeln (VII) und (XIII) bilden Komplexverbindungen vom Typ (XIV),

15



wobei in der allgemeinen Formel (XIV) M ein Metallzentrum, bevorzugt ein Übergangsmetallzentrum, L gleiche oder verschiedene koordinierende organische oder anorganische Liganden und P organische Liganden, erfindungsgemäß Isophosphindoline vom Typ (VII) oder (XIII) darstellen, S koordinierende Lösungsmittelmoleküle und Y Äquivalente aus nicht koordinierenden Anionen repräsentiert, wobei x und m ganzen Zahlen größer oder gleich 1, n, q und r ganzen Zahlen größer oder gleich 0 sind.

20

25

Die Summe  $m + n + q$  wird durch die an den Metallzentren zur Verfügung stehenden Koordinationszentren nach oben begrenzt, wobei nicht alle Koordinationsstellen besetzt sein müssen. Bevorzugt sind Komplexverbindungen mit oktaedrischer,

## Patentansprüche:

## 1. Komplexverbindungen der allgemeinen Formel (XIV)



wobei

M ein Metallzentrum,

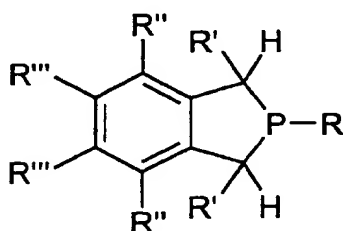
P organische Liganden,

L gleiche oder verschiedene organische oder anorganische Liganden,

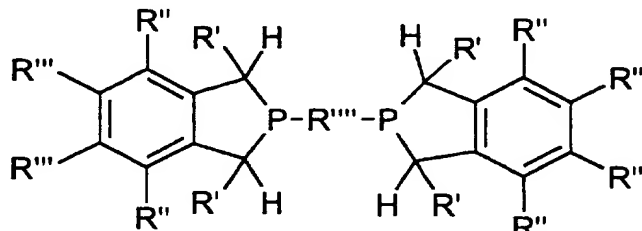
S koordinierende Lösemittelmoleküle und

Y nichtkoordinierende anionische Äquivalente

darstellen und worin x und m ganze Zahlen größer oder gleich 1, n, q und r ganze Zahlen größer oder gleich 0 sind dadurch gekennzeichnet, daß die Komplexverbindung ein oder mehrere gleiche oder verschiedene Isophosphindoline vom Typ (VII) oder (XIII)



(VII)



(XIII)

als Liganden P enthält, wobei in der allgemeinen Formel (VII)

R für Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R' für Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl-, Aryl, Haloalkyl- oder Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor steht und wobei zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt sein können,

oder wobei in der allgemeinen Formel (XIII)

R' für Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloalkyl- oder Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor steht und zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt sein können

und worin R'''' für eine Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe steht, wobei der Begriff Alkyl- bzw. Haloalkylgruppe die entsprechenden Cycloverbindungen einschließt.

2. Komplexverbindungen gemäß Anspruch 1 dadurch gekennzeichnet, daß die Summe  $m + n + q$  kleiner oder gleich  $6x$  ist.

3. Komplexverbindungen gemäß Anspruch 1 oder 2 dadurch gekennzeichnet, daß weniger als vier Metallzentren, bevorzugt ein oder zwei Metallzentren enthalten sind.

4. Komplexverbindungen gemäß einem der vorherigen Ansprüche dadurch gekennzeichnet, daß das Metallzentrum oder die Metallzentren  $M_x$  mindestens ein Übergangsmetall, insbesondere Palladium, Platin, Rhodium, Ruthenium, Osmium, Iridium, Kobalt, Nickel, oder/und Kupfer enthalten.

5. Komplexverbindungen gemäß einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Alkyl-, Aryl-, Haloalkyl-, Haloalkyl-, Alkoxy- oder/und Dialkylaminogruppen unabhängig voneinander jeweils 1 bis 20, vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, aufweisen.

6. Komplexverbindungen gemäß einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Haloalkyl- oder/und Haloarylgruppen  $CF_3$ ,  $CH_2CF_3$ ,  $C_2F_5$  darstellen.

7. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe R'''' 2 bis 20 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 2, 3, 4, 5 oder 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 2 oder 6 Kohlenstoffatome, aufweist.

8. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe R<sup>'''</sup> Ethan-1,2-diyl, Benzo-1,2-diyl oder Furan-3,4-diyl darstellt.
- 5 9. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß R Phenyl, R' Methyl oder Ethyl, R'' und R''' Wasserstoff, Methyl oder/und Phenylen, R<sup>'''</sup> Benzo-1,2-diyl ist.
- 10 10. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß es chirale Liganden P enthält.
- 15 11. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß ein Ligand P ein Isophosphindolin gemäß Formel (VII) ist, das zwei stereogene Zentren in den Positionen 1 und 3 mit gleichen absoluten Konfigurationen aufweist.
- 20 12. Komplexverbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 11, dadurch gekennzeichnet, daß ein Ligand P ein Isophosphindolin gemäß Formel (XIII) ist, das drei oder vier stereogene Zentren in den Positionen 1, 1', 3 und 3' mit gleichen absoluten Konfigurationen aufweist.
- 25 13. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß R Phenyl, R' Methyl, R'' und R''' Wasserstoff und R<sup>'''</sup> Benzo-1,2-diyl ist.
- 30 14. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß ein Enantiomer angereichert ist.
15. Verwendung einer Komplexverbindung nach einem der Ansprüchen 1 bis 15 als Katalysator für asymmetrische Reaktionen oder Polymerisationen, insbesondere für asymmetrische Hydrierungen, Transfer-Hydrierungen, Umlagerungen, Cyclopropanierungen, Heck-Reaktionen.



## PCT

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

1/10/01  
TECH CENTER 1600/2900

NOV 8 2001

RECEIVED

5

09/07/22  
Translation  
5650

Applicant's or agent's file reference 1998/F116 PCT	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP99/07084	International filing date (day/month/year) 23 September 1999 (23.09.99)	Priority date (day/month/year) 09 October 1998 (09.10.98)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07F 15/00, 9/6568		
Applicant AVENTIS RESEARCH & TECHNOLOGIES GMBH & CO. KG		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.	
2. This REPORT consists of a total of <u>5</u> sheets, including this cover sheet.	
<input checked="" type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).	
These annexes consist of a total of <u>7</u> sheets.	
3. This report contains indications relating to the following items:	
I	<input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report
II	<input type="checkbox"/> Priority
III	<input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
IV	<input type="checkbox"/> Lack of unity of invention
V	<input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
VI	<input type="checkbox"/> Certain documents cited
VII	<input checked="" type="checkbox"/> Certain defects in the international application
VIII	<input type="checkbox"/> Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 11 March 2000 (11.03.00)	Date of completion of this report 12 January 2001 (12.01.2001)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/07084

## I. Basis of the report

## 1. With regard to the elements of the international application:\*

- ☐ the international application as originally filed
- ☒ the description:  
pages 1-3,6,7,10-16, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages 4,5,8,9, filed with the letter of 13 November 2000 (13.11.2000)
- ☒ the claims:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement under Article 19  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages 1-15, filed with the letter of 13 November 2000 (13.11.2000)
- ☐ the drawings:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing part of the description:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

## 2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language \_\_\_\_\_ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

## 3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☒ the claims, Nos. 5
- ☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).\*\*

\* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

\*\* Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

**V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement****1. Statement**

Novelty (N)	Claims	1-15	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-15	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-15	YES
	Claims		NO

**2. Citations and explanations**

The following international search report citations were considered to be of relevance for the examination of the present application. The numbering is retained throughout the proceedings:

D1: CHEMISTRY AND INDUSTRY, Vol. 77, 27 September 1958 (1958-09-27), 1264

D2: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, May 1964 (1964-05), 1803-1814

D3: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, May 1964 (1964-05), 1815-1819

D4: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, May 1964 (1964-05), 1819-1825

D5: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, September 1964 (1964-09), 2117-2122.

**I. Novelty**

Documents D1-D5 disclose transition metal complexes of 2-phenylisophosphindoline. The subject matter of the present invention differs from these complexes in that the claimed complexes carry a 1,3-disubstituted isophosphindoline ligand. The ligands used as per the invention should correspond to formula (VII), in which R<sup>1</sup>

cannot be hydrogen.

**Consequently, the subject matter of the present invention as per Claims 1-15 can be regarded as novel over the aforementioned prior art. Therefore, these claims meet the requirements of PCT Article 33(2)).**

## **II. Inventive step**

The problem to be solved by the application consists firstly in providing a ligand parent structure which is analogous to the now well-known phospholane ligand, but which can also be varied electronically to a great extent, and also in using the transition metal complexes of these ligands as a catalyst for different reactions.

Documents D1-D5 are all considered to be the closest prior art and disclose the complexing of 2-phenylisophosphindoline, but not a use of the corresponding complexes in catalytic processes.

The solution to the aforementioned problem as suggested in the application is to use 1,3-disubstituted isophosphindolines as ligands.

**Since none of the aforementioned prior art documents suggests this solution, the subject matter of Claims 1-15 involves an inventive step and therefore meets the requirements of PCT Article 33(3).**

**VII. Certain defects in the international application**

The following defects in the form or contents of the international application have been noted:

1. Upon entry into the regional European phase, documents D1-D5 should be indicated and discussed briefly in the description.

# VERTRAG ÜBER INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

REC'D 17 JAN 2001

## PCT

PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT



(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 1998/F116 PCT	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/07084	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 23/09/1999	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag) 09/10/1998
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07F15/00		
Anmelder AVENTIS RESEARCH & TECHNOLOGIES GMBH & CO KG et al		

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.  
  
☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt 7 Blätter.

- Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:
  - ☒ Grundlage des Berichts
  - ☐ Priorität
  - ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
  - ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
  - ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
  - ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
  - ☒ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
  - ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  11/03/2000	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  12.01.2001
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Masson, J-P  Tel. Nr. +49 89 2399 8728 

**I. Grundlage des Berichts**

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten.*):

**Beschreibung, Seiten:**

1-3,6,7,10-16                      ursprüngliche Fassung

4,5,8,9                              eingegangen am                      16/11/2000      mit Schreiben vom                      13/11/2000

**Patentansprüche, Nr.:**

1-15                                      eingegangen am                      16/11/2000      mit Schreiben vom                      13/11/2000

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,                      Seiten:
- ☒ Ansprüche,                      Nr.:                      5

☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

*(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).*

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche	1-15
	Nein: Ansprüche	
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	1-15
	Nein: Ansprüche	
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-15
	Nein: Ansprüche	

2. Unterlagen und Erklärungen  
**siehe Beiblatt**

**VII. Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung**

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:  
**siehe Beiblatt**



### **Zu Punkt V**

Die folgenden im internationalen Recherchenbericht angegebenen Dokumente wurden für die Prüfung der vorliegenden Anmeldung als relevant betrachtet. Ihre Numerierung wird während des ganzen Verfahrens beibehalten :

- D1: CHEMISTRY AND INDUSTRY, Bd. 77, 27. September 1958 (1958-09-27), 1264
- D2: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, Mai 1964 (1964-05), 1803-1814
- D3: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, Mai 1964 (1964-05), 1815-1819
- D4: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, Mai 1964 (1964-05), 1819-1825
- D5: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, September 1964 (1964-09), 2117-2122

### **I. Neuheit**

Die Dokumente D1-D5 offenbaren Übergangsmetallkomplexe von 2-Phenylisophosphindolin. Von diesen Komplexen unterscheidet sich der Gegenstand der vorliegenden Erfindung dadurch, daß die erfindungsgemäßen Komplexe einen 1,3-disubstituierten Isophosphindolin-Liganden tragen. Die erfindungsgemäß benutzten Liganden sollen nämlich der Formel (VII) entsprechen, worin R' kein Wasserstoff sein kann.

**Daher kann der Gegenstand der vorliegenden Erfindung gemäß Ansprüche 1-15 gegenüber dem obengenannten Stand der Technik als neu erachtet werden.** Somit entsprechen diese Ansprüche den Anforderungen des Art. 33(2) PCT.

### **II. Erfinderische Tätigkeit**

Die von der Anmeldung zu lösende Aufgabe besteht darin, ein Ligand-Grundgerüst zur Verfügung zu stellen, das dem nun wohl bekannten Phospholanliganden analog, aber darüber hinaus elektronisch in breitem Rahmen variierbar ist, und die

Übergangsmetallkomplexe dieser Liganden als Katalysator für verschiedene Reaktionen zu verwenden.

Die Dokumente D1-D5, die alle als naheliegender Stand der Technik angesehen werden, offenbaren die Komplexierung von 2-Phenylisophosphindolin, aber keine Verwendung von den entsprechenden Komplexen in katalytischen Prozessen.

Die in der Anmeldung für die obengenannte Aufgabe vorgeschlagene Lösung besteht darin, 1,3-disubstituierte Isophosphindoline als Liganden zu benutzen.

**Da kein Dokument aus dem obengenannten Stand der Technik diese Lösung nahelegt, beruht der Gegenstand der Ansprüche 1-15 auf einer erfinderischen Tätigkeit** und entspricht somit den Anforderungen des Art. 33(3) PCT.

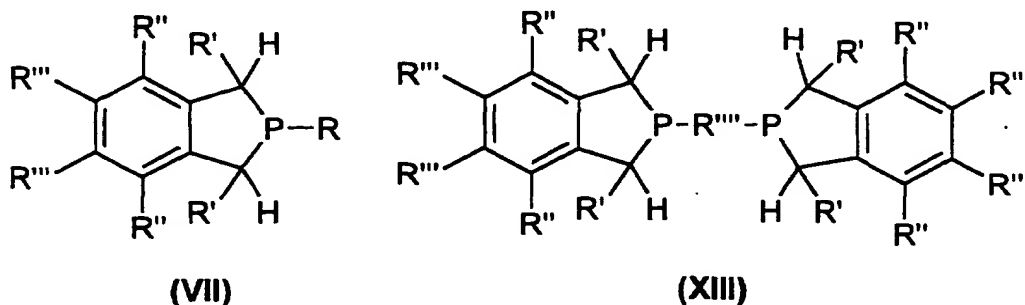
#### **Zu Punkt VII**

1. Beim Eintreten ins regionale Europäische Verfahren sollten die Dokumente D1-D5 in der Beschreibung erwähnt und kurz diskutiert werden.

Phospholanliganden analog, aber darüber hinaus elektronisch in breitem Rahmen variierbar ist.

Diese Aufgabe wird mit der Bereitstellung von substituierten Isophosphindolinen gemäß Formel (VII) oder (XIII) gelöst,

5



wobei in der allgemeinen Formel (VII)

R Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

10 R' Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander Wasserstoff, Alkyl-, Aryl, Haloalkyl- oder Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor bedeuten

und wobei zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt sein können

15

oder wobei in der allgemeinen Formel (XIII)

R' Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloalkyl- oder Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor bedeuten

20

und zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt sein können und

R'''' eine Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe ist.

25

Der Begriff Alkyl- bzw. Haloalkylgruppe soll dabei die entsprechenden Cycloverbindungen einschließen. Bevorzugt sind insbesondere chirale substituierte Isophosphindoline.

Vorzugsweise weist das erfindungsgemäße substituierte Isophosphindolin Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkyl-, Alkoxy- oder/und Dialkylaminogruppen unabhängig voneinander auf, die jeweils 1 bis 20, insbesondere 1 bis 6 Kohlenstoffatome, enthalten.

5

Die Haloalkyl- oder/und Haloarylgruppen weisen vorzugsweise die allgemeinen Formeln  $\text{CHal}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CHal}_3$ ,  $\text{C}_2\text{Hal}_5$  auf, wobei Hal insbesondere für F, Cl und Br stehen kann. Besonders bevorzugt sind Haloalkyl- oder/und Haloarylgruppen der Formeln  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CF}_3$ ,  $\text{C}_2\text{F}_5$ .

10

Weiterhin ist bevorzugt, daß die Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe  $\text{R}''''$  des substituierten Isophosphindolins 2 bis 20 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 2, 3, 4, 5 oder 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 2 oder 6 Kohlenstoffatome, aufweist. Ethan-1,2-diyl, Benzo-1,2-diyl oder Furan-3,4-diyl sind besonders bevorzugte

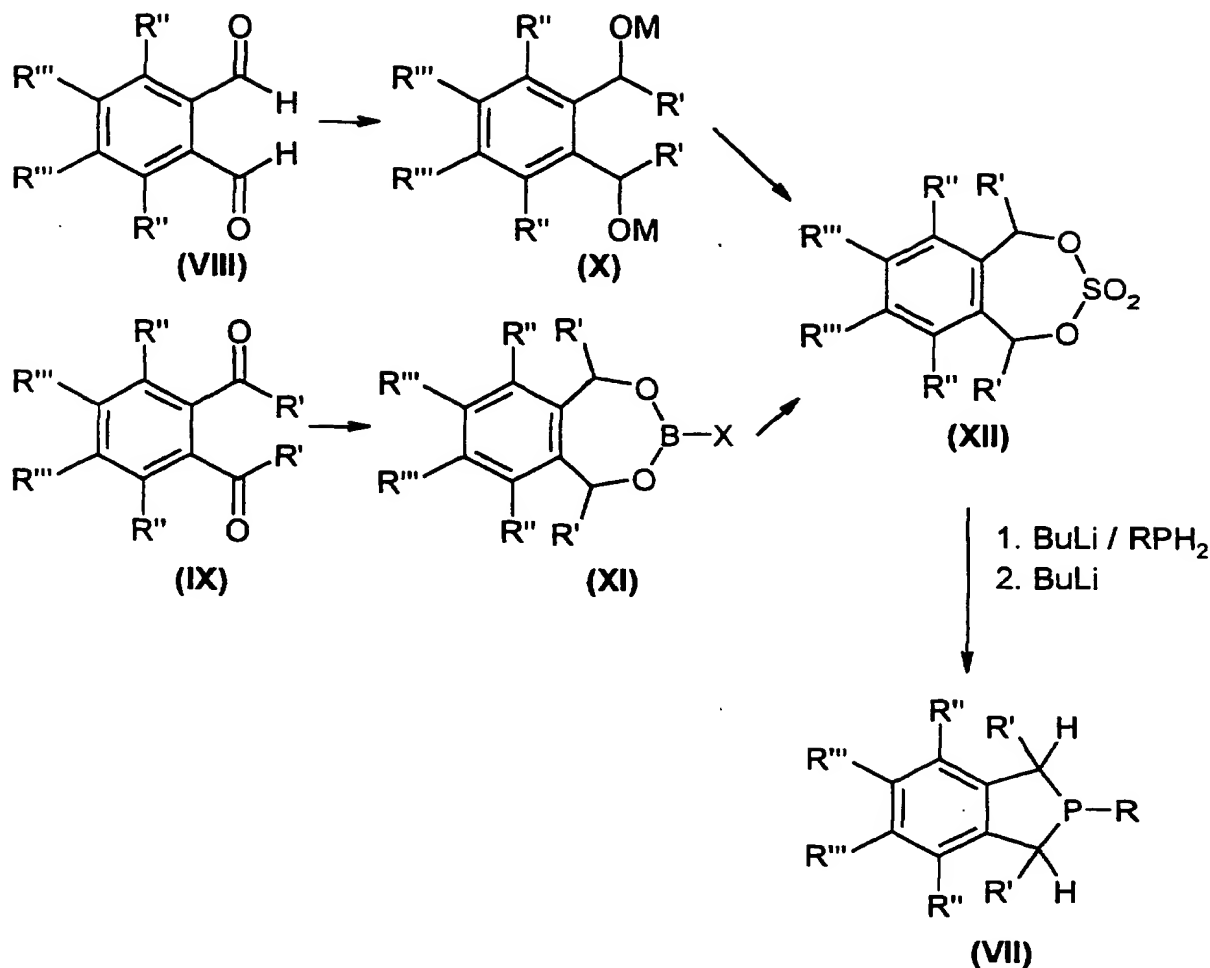
15 Gruppen der Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe  $\text{R}''''$ .

Ferner ist ein substituiertes Isophosphindolin bevorzugt, bei dem R Phenyl,  $\text{R}'$  Methyl oder Ethyl,  $\text{R}''$  und  $\text{R}'''$  Wasserstoff, Methyl oder/und Phenylen,  $\text{R}''''$  Benzo-1,2-diyl ist. Besonders bevorzugt ist ein substituiertes Isophosphindolin, bei dem R Phenyl, 20  $\text{R}'$  Methyl oder Ethyl,  $\text{R}''$  und  $\text{R}'''$  Wasserstoff, Methyl oder/und Phenylen,  $\text{R}''''$  Benzo-1,2-diyl ist, bei dem  $\text{R}''$  und  $\text{R}'''$  nicht Wasserstoff ist oder bei dem entweder  $\text{R}''$  oder  $\text{R}'''$  Wasserstoff ist.

Weiterhin sind substituierte Isophosphindoline bevorzugt, die stereogene Zentren in 25 1- und 3-Position mit gleichen absoluten Konfigurationen. Bei substituiertem Isophosphindolin gemäß Formel (VII) weist dieses zwei stereogene Zentren in den Positionen 1 und 3 mit gleichen absoluten Konfigurationen auf, bei solchen gemäß Formel (XIII) weist jenes drei oder vier stereogene Zentren in den Positionen 1, 1', 3 und 3' mit gleichen absoluten Konfigurationen auf.

30

Schließlich sind substituierte chirale Isophosphindole bevorzugt, bei denen ein Enantiomer angereichert ist.

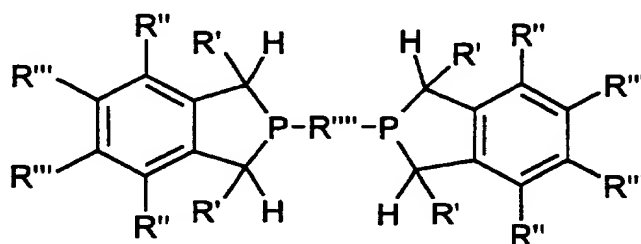


Die Umsetzung des Sulfats der allgemeinen Formel (XII) mit Phosphanen der allgemeinen Formel RPH<sub>2</sub> (R = Alkyl, Aryl, Heteroarendiyl) liefert in Abwandlung von bekannten Verfahren (Burk US 5,386,061) über die entsprechenden Phosphide das entsprechende substituierte Isophosphindolin.

Es ist ebenso möglich, das Sulfat der allgemeinen Formel (XII) als Isomerengemisch zum entsprechenden Gemisch isomerer Isophosphindoline umzusetzen und im Anschluß daran eine Trennung durchzuführen, um stereochemisch reine substituierte Isophosphindoline zu erhalten. Diese Trennung läßt sich beispielsweise durch fraktionierte Kristallisation und/oder chromatographisch erreichen.

Als Phosphane der allgemeinen Formel RPH<sub>2</sub> sind alle Arten von Aryl- und Alkylphosphanen als Ausgangssubstanzen einsetzbar (R = Aryl, Alkyl). Falls stattdessen Diphosphane der allgemeinen Formel H<sub>2</sub>P- R'''-PH<sub>2</sub> verwendet werden,

so entstehen Chelatliganden der allgemeinen Formel (XIII), die im Falle von  $C_2$ -symmetrischen Sulfaten der allgemeinen Formel (XII) zu chiralen und dann ebenfalls  $C_2$ -symmetrischen Chelatliganden führen.



(XIII)

Die Verbindungen der allgemeinen Formeln (VII) und (XIII) können als Liganden an Metallen in asymmetrischen, Metall-katalysierten Reaktionen (wie z. B. der asymmetrischen Hydrierung, der Transfer-Hydrierungen, der asymmetrischen Umlagerung, der asymmetrischen Cyclopropanierung oder Heck-Reaktionen) sowie bei Polymerisationen eingesetzt werden. Sie sind insbesondere für asymmetrische Reaktionen gut geeignet.

Die Liganden der allgemeinen Formeln (VII) und (XIII) bilden Komplexverbindungen vom Typ (XIV),

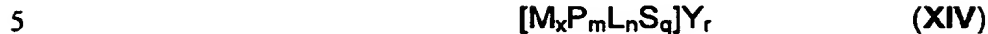


wobei in der allgemeinen Formel (XIV) M ein Metallzentrum, bevorzugt ein Übergangsmetallzentrum, L gleiche oder verschiedene koordinierende organische oder anorganische Liganden und P organische Liganden, erfindungsgemäß Isophosphindoline vom Typ (VII) oder (XIII) darstellen, S koordinierende Lösungsmittelmoleküle und Y Äquivalente aus nicht koordinierenden Anionen repräsentiert, wobei x und m ganzen Zahlen größer oder gleich 1, n, q und r ganzen Zahlen größer oder gleich 0 sind.

Die Summe  $m + n + q$  wird durch die an den Metallzentren zur Verfügung stehenden Koordinationszentren nach oben begrenzt, wobei nicht alle Koordinationsstellen besetzt sein müssen. Bevorzugt sind Komplexverbindungen mit oktaedrischer,

## Patentansprüche:

## 1. Komplexverbindungen der allgemeinen Formel (XIV)



wobei

M ein Metallzentrum,

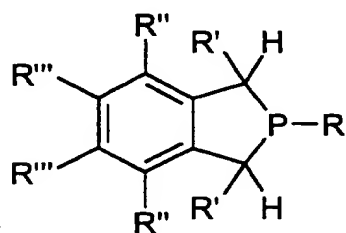
P organische Liganden,

L gleiche oder verschiedene organische oder anorganische Liganden,

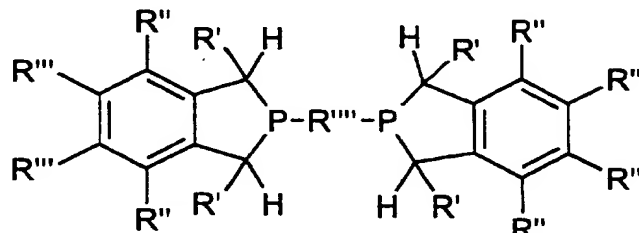
S koordinierende Lösemittelmoleküle und

Y nichtkoordinierende anionische Äquivalente

darstellen und worin x und m ganze Zahlen größer oder gleich 1, n, q und r ganze Zahlen größer oder gleich 0 sind dadurch gekennzeichnet, daß die Komplexverbindung ein oder mehrere gleiche oder verschiedene Isophosphindoline vom Typ (VII) oder (XIII)



(VII)



(XIII)

als Liganden P enthält, wobei in der allgemeinen Formel (VII)

R für Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R' für Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl-, Aryl, Haloalkyl- oder Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor steht und wobei zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt sein können,

oder wobei in der allgemeinen Formel (XIII)

R' für Alkyl-, Aryl-, Haloaryl-, Haloalkylgruppen,

R'' und R''' unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl-, Aryl-, Haloalkyl- oder Haloaryl-, Alkoxy-, Amino-, Dialkylamino-, Sulfonatgruppen oder Fluor steht und zwei benachbarte R''/R'', R''/R''' oder R'''/R''' auch verbrückt sein können

und worin R'''' für eine Alkandiy-, Arendiy- oder Heteroarendiygruppe steht, wobei der Begriff Alkyl- bzw. Haloalkylgruppe die entsprechenden Cycloverbindungen einschließt.

2. Komplexverbindungen gemäß Anspruch 1 dadurch gekennzeichnet, daß die Summe  $m + n + q$  kleiner oder gleich  $6x$  ist.

3. Komplexverbindungen gemäß Anspruch 1 oder 2 dadurch gekennzeichnet, daß weniger als vier Metallzentren, bevorzugt ein oder zwei Metallzentren enthalten sind.

4. Komplexverbindungen gemäß einem der vorherigen Ansprüche dadurch gekennzeichnet, daß das Metallzentrum oder die Metallzentren  $M_x$  mindestens ein Übergangsmetall, insbesondere Palladium, Platin, Rhodium, Ruthenium, Osmium, Iridium, Kobalt, Nickel, oder/und Kupfer enthalten.

5. Komplexverbindungen gemäß einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Alkyl-, Aryl-, Haloalkyl-, Haloalkyl-, Alkoxy- oder/und Dialkylaminogruppen unabhängig voneinander jeweils 1 bis 20, vorzugsweise 1 bis 6 Kohlenstoffatome, aufweisen.

6. Komplexverbindungen gemäß einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Haloalkyl- oder/und Haloarylgruppen  $CF_3$ ,  $CH_2CF_3$ ,  $C_2F_5$  darstellen.

7. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Alkandiy-, Arendiy- oder Heteroarendiygruppe R'''' 2 bis 20 Kohlenstoffatome, vorzugsweise 2, 3, 4, 5 oder 6 Kohlenstoffatome, insbesondere 2 oder 6 Kohlenstoffatome, aufweist.



8. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß die Alkandiyl-, Arendiyl- oder Heteroarendiylgruppe R<sup>'''</sup> Ethan-1,2-diyl, Benzo-1,2-diyl oder Furan-3,4-diyl darstellt.
- 5 9. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß R Phenyl, R' Methyl oder Ethyl, R<sup>''</sup> und R<sup>'''</sup> Wasserstoff, Methyl oder/und Phenylen, R<sup>''''</sup> Benzo-1,2-diyl ist.
- 10 10. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß es chirale Liganden P enthält.
- 15 11. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß ein Ligand P ein Isophosphindolin gemäß Formel (VII) ist, das zwei stereogene Zentren in den Positionen 1 und 3 mit gleichen absoluten Konfigurationen aufweist.
- 20 12. Komplexverbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 11, dadurch gekennzeichnet, daß ein Ligand P ein Isophosphindolin gemäß Formel (XIII) ist, das drei oder vier stereogene Zentren in den Positionen 1, 1', 3 und 3' mit gleichen absoluten Konfigurationen aufweist.
- 25 13. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß R Phenyl, R' Methyl, R<sup>''</sup> und R<sup>'''</sup> Wasserstoff und R<sup>''''</sup> Benzo-1,2-diyl ist.
- 30 14. Komplexverbindungen nach einem der vorherigen Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß ein Enantiomer angereichert ist.
15. Verwendung einer Komplexverbindung nach einem der Ansprüche 1 bis 15 als Katalysator für asymmetrische Reaktionen oder Polymerisationen, insbesondere für asymmetrische Hydrierungen, Transfer-Hydrierungen, Umlagerungen, Cyclopropanierungen, Heck-Reaktionen.



JC17 ~~10~~ d PCT/PTO 2.8 JUN 2001 PCT  
198at29 (8602\*32)

IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE

APPLICANT: KARL-JOSEF HAACK *ET AL.*

SERIAL NO. 09/807,122

FILED:

FOR: SUBSTITUTED ISOPHOSPHINDOLINES  
AND THEIR USE

) ART UNIT: TO BE ASSIGNED

) EXAMINER: TO BE ASSIGNED

RECEIVED

AUG 27 2001

Asst. Commissioner for Patents

Washington, D.C. 20231

TECH CENTER 1600/2900

HEREBY CERTIFY THAT THIS CORRESPONDENCE IS BEING DEPOSITED WITH THE UNITED STATES POSTAL SERVICE AS FIRST-CLASS MAIL IN AN ENVELOPE ADDRESSED TO: ASST. COMMISSIONER FOR PATENTS AND TRADEMARKS, WASHINGTON D.C. 20231 ON THIS 25<sup>th</sup> DAY OF June 2001. BY: Caree A. McPherson

SUBMISSION OF PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

Sir:

Enclosed with this paper is a copy of the International Preliminary Examination Report (PCT/EP98/04240). The Examiner will note, that the report indicates that the claims are novel, have inventive step and industrial applicability.

No additional fee is due. If there are any additional fees due in connection with the filing of this response, including any fees required for an additional extension of time under 37 CFR 1.136, such an extension is requested and the Commissioner is authorized to charge or credit any overpayment to Deposit Account No. 03-2775.

Respectfully submitted,

CONNOLLY, BOVE, LODGE & HUTZ, LLP

By Ashley I. Pezzner

Ashley I. Pezzner  
Reg. No. 35,646

Tel. (302) 888-6270

AIP/cam

::ODMA\HODMA\CB;149965;1



## PATENT COOPERATION TREATY

## PCT

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

RECEIVED

AUG 27 2001

TECH CENTER 1600/2900

Applicant's file reference 1998/F116 PCT		<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP99/07084	International filing date (day/month/year) 23 September 1999 (23.09.99)	Priority date (day/month/year) 09 October 1998 (09.10.98)	
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07F 15/00, 9/6568			
Applicant AVENTIS RESEARCH & TECHNOLOGIES GMBH & CO. KG			

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.
- ☒ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).
- These annexes consist of a total of 7 sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☒ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 11 March 2000 (11.03.00)	Date of completion of this report 12 January 2001 (12.01.2001)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/07084

## I. Basis of the report

## 1. With regard to the elements of the international application:\*

- ☐ the international application as originally filed
- ☒ the description:  
pages 1-3,6,7,10-16, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages 4,5,8,9, filed with the letter of 13 November 2000 (13.11.2000)
- ☒ the claims:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement under Article 19  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages 1-15, filed with the letter of 13 November 2000 (13.11.2000)
- ☐ the drawings:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing part of the description:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

## 2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language \_\_\_\_\_ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

## 3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☒ the claims, Nos. 5
- ☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).\*\*

\* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

\*\* Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 99/07084

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-15	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-15	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-15	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

The following international search report citations were considered to be of relevance for the examination of the present application. The numbering is retained throughout the proceedings:

D1: CHEMISTRY AND INDUSTRY, Vol. 77, 27 September 1958 (1958-09-27), 1264

D2: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, May 1964 (1964-05), 1803-1814

D3: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, May 1964 (1964-05), 1815-1819

D4: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, May 1964 (1964-05), 1819-1825

D5: JOURNAL CHEMICAL SOCIETY, September 1964 (1964-09), 2117-2122.

**I. Novelty**

Documents D1-D5 disclose transition metal complexes of 2-phenylisophosphindoline. The subject matter of the present invention differs from these complexes in that the claimed complexes carry a 1,3-disubstituted isophosphindoline ligand. The ligands used as per the invention should correspond to formula (VII), in which R<sup>1</sup>

cannot be hydrogen.

**Consequently, the subject matter of the present invention as per Claims 1-15 can be regarded as novel over the aforementioned prior art.** Therefore, these claims meet the requirements of PCT Article 33(2)).

## **II. Inventive step**

The problem to be solved by the application consists firstly in providing a ligand parent structure which is analogous to the now well-known phospholane ligand, but which can also be varied electronically to a great extent, and also in using the transition metal complexes of these ligands as a catalyst for different reactions.

Documents D1-D5 are all considered to be the closest prior art and disclose the complexing of 2-phenylisophosphindoline, but not a use of the corresponding complexes in catalytic processes.

The solution to the aforementioned problem as suggested in the application is to use 1,3-disubstituted isophosphindolines as ligands.

**Since none of the aforementioned prior art documents suggests this solution, the subject matter of Claims 1-15 involves an inventive step** and therefore meets the requirements of PCT Article 33(3).

**VII. Certain defects in the international application**

The following defects in the form or contents of the international application have been noted:

1. Upon entry into the regional European phase, documents D1-D5 should be indicated and discussed briefly in the description.